

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
23. Oktober 2003 (23.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 03/086360 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 9/20

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/03910

(22) Internationales Anmeldedatum:  
15. April 2003 (15.04.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 16 551.3 15. April 2002 (15.04.2002) DE  
202 05 854.9 15. April 2002 (15.04.2002) DE

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder und

(72) Erfinder: BEISEL, Günther [DE/DE]; Schloss Laach, 40789 Monheim (DE).

(74) Anwalt: FITZNER, Uwe; Lintorfer Strasse 10, 40878 Ratingen (DE).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.



WO 03/086360 A1

(54) Title: AGENT FOR PRODUCING A SENSATION OF SATIETY AND FOR WEIGHT LOSS

(54) Bezeichnung: MITTEL ZUR ERZEUGUNG EINES SÄTTIGUNGSEFFEKTS UND ZUR GEWICHTSREDUKTION

(57) Abstract: The invention relates to an improved agent for producing a sensation of satiety and for weight loss, consisting of a dried, porous gel or foam of at least one anionic polymer, whereby the gel or foam is present as an aluminium salt. The inventive agent is also suitable for controlling cholesterol metabolism.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein verbessertes Mittel zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion aus getrocknetem porösen Gel oder Schaum als wenigstens eines anionischen Polymers, wobei das Gel oder der Schaum als Aluminiumsalz vorliegt. Ferner eignet sich das erfindungsgemäße Mittel auch zur Regulierung des Cholesterinhaushalts.

AQ2

**Mittel zur Erzeugung eines Sättigungseffekts und zur  
Gewichtsreduktion**

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Mittel zur Erzeugung eines Sättigungseffekts und zur Gewichtsreduktion. Ferner eignet sich das erfindungsgemäße Mittel ebenso zur Regulierung des Cholesterinhaushalts.

Es sind zahlreiche Versuche unternommen worden, auf medikamentösem Weg überflüssige Fettanreicherungen im menschlichen Körper abzubauen beziehungsweise deren Entstehung zu verhindern. Es gibt z.B. sogenannte Appetitzügler, die den Körper auf biochemischem Weg eine Abneigung zur Nahrungsaufnahme zu suggerieren versuchen. Diese Mittel haben zum Teil erhebliche schädliche Nebenwirkungen.

Neben den zahlreichen bekannten Diätvorschlägen gibt es auch mechanische und elektromechanische Mittel, mit denen ein gezielter Fettabbau beziehungsweise Muskelaufbau erfolgen soll. Die Wirkung solcher Mittel ist jedoch sehr zweifelhaft.

Aus der DE 4025912 ist ein Mittel zur oralen Einnahme bekannt, das aus einem im Magen löslichen und den Inhalt freigebenden Behälter besteht. Dieser ist mit einem Stoff gefüllt, der nach seinem Freisetzen im Magen sein Volumen vergrößert und dadurch dem Körper ein Sättigungsgefühl suggeriert. Nachteil dieses Sättigungsmittels ist, daß die Gefahr von Darmverschlüssen besteht.

Ferner sind aus DE 199 42 417 Schwamm-artige Zubereitungen mit stabil vernetzten Querverbindungen bekannt, die im Magen ihr Volumen vergrößern und so ein Sättigungsgefühl hervorrufen. Jedoch erfordert die

Herstellung dieser Zubereitungen zusätzliche Verfahrensschritte zur Einführung stabiler Quervernetzungen.

Aufgrund des ständig steigenden Gesundheitsbewußtseins ist jedoch eine  
5 weitere Verbesserung von Mitteln zur Erzeugung eines Sättigungseffekts von hoher medizinischer und wirtschaftlicher Relevanz.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist es, ein verbessertes Mittel zur oralen Einnahme zur Verfügung zu stellen, das eine höhere  
10 Magenverweilzeit aufweist als bekannte Mittel seiner Art und dadurch zu einem effektiveren Sättigungseffekt führt. Ferner sollte es zur Gewichtsreduzierung geeignet sein. Ebenso vorteilhaft wäre seine Eignung zur Regulierung des Cholesterinspiegels, da Übergewichtigkeit in der Regel mit einem überhöhten Cholesterinspiegel einhergeht. Darüber  
15 hinaus ist eine einfache Herstellung aus preiswerten Rohstoffen wünschenswert, die keine gesundheitlichen Risiken in sich bergen.

Die vorliegende Aufgabe wird gelöst, durch ein Mittel zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion aus getrocknetem porösen  
20 Gel oder Schaum wenigstens eines anionischen Polymers, wobei das Gel oder der Schaum als Aluminiumsalz vorliegt.

Erfindungsgemäß bevorzugte anionische Polymere sind Polysaccharide und hier Polyuronsäure-haltige Polysaccharide, wie Alginsäuren und  
25 deren Salze (Alginate). Aber auch niederveresterte Pectine, Xanthan, Tragant, Chondroitinsulfat sowie alle anderen Uronsäure-haltigen Verbindungen können erfindungsgemäß zum Einsatz kommen. Denkbar ist auch die Verwendung von synthetischen oder halbsynthetischen Cellulosederivaten, wie z.B. Carboxymethylcellulose oder von  
30 Polyacrylaten.

Erfindungsgemäß vorteilhaft sind getrocknete Gele oder Schäume  
enthaltend Mischungen anionischer Polymere, bevorzugt der zuvor  
erwähnten anionischen Polysaccharide, besonders bevorzugt Mischungen  
Polyuronsäure-haltiger und niederveresterter Polysaccharide und  
5 insbesondere Mischungen enthaltend Salze von Alginsäure und Pektin.

Alginsäure ist eine lineare Polyuronsäure aus wechselnden Anteilen von  
D-Mannuronsäure und L-Guluronsäure, die durch  $\beta$ -glykosidische  
Bindungen miteinander verknüpft sind, wobei die Carboxylgruppen nicht  
10 verestert sind. Ein Molekül Alginsäure kann sich aus etwa 150-1050  
Uronsäure-Einheiten zusammensetzen, wobei das durchschnittliche  
Molekulargewicht in einem Bereich von 30-200 kDa variieren kann.

Das Polysaccharid Alginsäure ist ein Bestandteil der Zellwänden von  
15 Braunalgen. Der Anteil der Alginsäure an der Trockenmasse der Algen  
kann hierbei bis zu 40% ausmachen. Die Gewinnung der Alginsäure  
erfolgt durch alkalische Extraktion mit an sich bekannten Methoden  
gemäß dem Stand der Technik. Die resultierende pulverförmige  
Alginsäure ist somit rein pflanzlich und weist eine hohe Biokompatibilität  
20 auf. Sie kann unter Bildung hochviskoser Lösungen die 300-fache Menge  
ihres Eigengewichtes an Wasser aufnehmen. In Gegenwart von  
mehrwertigen Kationen bildet Alginsäure sogenannte Gele. Die Bildung  
von Alginatgelen in Gegenwart zweiwertiger Kationen, wie Calcium oder  
Barium, sind bei Shapiro I., et al. (Biomaterials, 1997, 18: 583-90)  
25 beschrieben. Letzteres ist aufgrund seiner Toxizität für den Einsatz in  
Biomedizin jedoch nicht geeignet. Neben Calcium-Chlorid liefert auch  
Calcium-Glukonat geeignete zweiwertige Kationen. Denkbar ist auch der  
Einsatz von Magnesium-Salzen oder eine Mischung verschiedener  
physiologisch unbedenklicher zweiwertiger Kationen.

Hinsichtlich der anionischen Polymere ist auch der Einsatz niederveresterter Pektine erfindungsgemäß vorteilhaft. Pektine bestehen aus Ketten von  $\alpha$ -1,4-glykosidisch verbundenen Galakturonsäure-Einheiten, deren Säuregruppen zu 20-80% mit Methanol verestert sind.

5 Man unterscheidet zwischen hochveresterten ( $> 50\%$ ) und niedrigveresterten ( $< 50\%$ ) Pektinen. Die Molmasse variiert zwischen 10-500 kDa. Die Gewinnung von Pektinen erfolgt durch saure Extraktion mit an sich bekannten Methoden gemäß dem Stand der Technik aus den inneren Anteilen von Citrusfruchtschalen, Obstrestern oder

10 Zuckerrübenschnitzeln. Die resultierenden Pektine (Apfel-Pektin, Citrus-Pektin) sind somit rein pflanzlich und weisen eine hohe Biokompatibilität auf. Sie können unter Wasseraufnahme Gele bilden.

Auch hier ist der Einsatz von Pektingelen in Gegenwart zweiwertiger Kationen, wie Calcium oder Barium bekannt. Letzteres ist auch hier

15 aufgrund seiner Toxizität für den Einsatz in Biomedizin jedoch nicht geeignet. Neben Calcium-Chlorid liefert auch Calcium-Glukonat geeignete zweiwertige Kationen. Denkbar ist auch der Einsatz von Magnesium-Salzen oder eine Mischung verschiedener physiologisch unbedenklicher zweiwertiger Kationen.

20 Ferner zeichnet sich der erfindungsgemäße Einsatz von Pektinen in vorteilhafter Weise dadurch aus, daß Pektine cholesterinsenkende Eigenschaften besitzen. Diese Eigenschaft ist im Sinne der vorliegenden Erfindung von Vorteil, da Übergewicht in der Regel mit einem erhöhten

25 Cholesterinspiegel einhergeht.

Verfahren zur Herstellung von Trockengelen oder Trockenschäumen aus Alginat sind bekannt. Hierbei wird beispielsweise eine Lösung von Natriumalginat in Wasser hergestellt und unter Zugabe von Calciumsalzen

30 eingedickt. Durch Einarbeiten von Luft und ggf. nach Zugabe von Tensiden kann ein Gel oder Schaum erhalten werden. Durch Einfrieren

und anschließendes Gefriertrocknen wird aus dem Alginatgel oder –  
schaum ein Trockengel oder Trockenschaum (Schwamm) hergestellt. Die  
Herstellung von Pektin-haltigen Gelen oder Schäumen erfolgt in analoger  
Weise, ebenso wie die Herstellung von Gelen oder Schäumen enthaltend  
5 Mischungen anionischer Polymere.

Neben der Zugabe von anorganischen oder organischen Calciumsalzen,  
wie z.B. Calciumchlorid oder Calciumglukonat, ist auch die Verwendung  
von Magnesiumsalzen denkbar sowie von Mischungen verschiedener  
physiologisch unbedenklicher zweiwertiger Kationen.

10

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt erfolgt die Zugabe von Salzen  
physiologisch unbedenklicher dreiwertiger Kationen, bevorzugt von  
löslichen Aluminiumsalzen. Hierbei kann die Herstellung der  
erfindungsgemäßen Mittel durch die Zugabe von löslichen  
15 Aluminiumsalzen zu einer wässrigen Lösung von anionischen Polymeren,  
bevorzugt Alginaten und/oder Pektinen, nach einem Herstellungsverfahren  
der zuvor beschriebenen Art erfolgen. Besonders geeignete lösliche  
Aluminiumsalze sind Aluminiumchlorid oder Aluminiumsulfat. Die löslichen  
Aluminiumsalze können alleine oder in Kombination eingesetzt werden.

20

Erfindungsgemäß können neben den löslichen Aluminiumsalzen, die  
ihrerseits allein oder in Kombination verwendet werden können, zusätzlich  
auch noch Salze zweiwertiger Kationen, wie z. B. Calcium- oder  
Magnesiumsalze oder deren Kombination, bei der Herstellung der  
erfindungsgemäßen Mittel eingesetzt werden.

25

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist somit auch eine Verfahren zur  
Herstellung eines verbesserten Mittels zur Erzielung eines  
Sättigungseffektes oder zur Gewichtsreduktion, bei dem zur Herstellung  
eins getrockneten Gels oder Schaums wenigstens eines anionischen  
30 Polymers wasserlösliche Salze enthaltend dreiwertige Kationen, bevorzugt  
Aluminiumsalze, besonders bevorzugt Aluminiumchlorid oder

Aluminiumsulfat, eingesetzt werden. Ferner können zusätzlich auch Salze physiologisch unbedenklicher zweiwertiger Kationen eingesetzt werden sowie denkbare Kombinationen von Salzen zwei- und/oder dreiwertiger Kationen. Außerdem ist der Einsatz anionischer Polymere einzeln oder in  
5 Kombination erfindungsgemäß umfaßt.

Das erfindungsgemäße Mittel zur oralen Einnahme enthält wenigstens ein anionisches Polymer in Form seines Aluminiumsalzes.

Vorteilhaft enthält das erfindungsgemäße Mittel als anionisches Polymer  
10 Alginat oder Pectin oder eine Kombination davon. Bevorzugt liegt das erfindungsgemäße Mittel als Aluminium-Alginat oder Aluminium-Pektin oder eine Mischung von Aluminium-Alginat und Aluminium-Pektin vor.

Das Salz dreiwertiger Kationen, bevorzugt in Form eines Aluminiumsalzes,  
15 bildet mit den anionischen Polymeren, bevorzugt Alginaten oder Pektinen, einen stabileren Komplex als bislang genutzte Salze zweiwertiger Kationen. Darüber hinaus ist Aluminium im Vergleich mit Barium physiologisch unbedenklich. Die stabilere Wechselwirkung der erfindungsgemäßen anionischen Polymere mit Salzen dreiwertiger  
20 Kationen verleiht dem erfindungsgemäßen Mittel die vorteilhafte Eigenschaft, daß es einerseits in Lösungen mit einem pH-Wert von 1 bis 5, bevorzugt von 1 bis 4, besonders bevorzugt in Lösungen mit einem pH-Wert vergleichbar des Magens oder im Magen selbst, unlöslich oder nur schwer löslich ist und sich andererseits in neutralen bis schwach sauren  
25 Lösungen mit einem pH-Wert von etwa 6 bis 7, bevorzugt mit einem pH-Wert vergleichbar zu dem des Darms oder im Darm selbst, vollständig auflöst. Die Auflösung des erfindungsgemäßen Mittels enthaltend Aluminium-Alginate beginnt beispielsweise bei einem pK-Wert von etwa 3,3 bis 3,7.

Neben dem zuvor beschriebenen Verhalten der erfindungsgemäßen Mittel hinsichtlich ihrer Löslichkeit weisen die Mittel außerdem die vorteilhafte Eigenschaft auf, daß sie eine gesteigerte Formstabilität vorweisen. Diese Formstabilität ist vor allem bei Mitteln enthaltend Mischungen anionischer Polymere in Form ihrer Aluminiumsalze, bevorzugt Mischungen aus Aluminium-Alginat und Aluminium-Pektinat, besonders stark ausgeprägt. Unter Formstabilität ist im Sinne der Erfindung zu verstehen, daß das erfindungsgemäße Mittel enthaltend Aluminiumsalze anionischer Polymere im Vergleich mit Gelen oder Schäumen enthaltend alleine Calciumsalze anionischer Polymere in Lösungen mit einem pH-Wert von etwa 1 bis 5 nicht schrumpfen. D.h. bekannte Mittel aus Calciumsalzen anionischer Polymere weisen den Nachteil auf, daß sie in sauren Lösungen mindestens ein Drittel ihres Volumens, meist sogar noch mehr, einbüßen. Der Vorteil der Formstabilität der erfindungsgemäßen Mittel wirkt sich somit direkt positiv auf ihre Eigenschaft zur Erzeugung eines Sättigungseffektes oder zur Gewichtsreduktion aus, da beim Eintritt des erfindungsgemäßen Mittels in den Magen kein Volumenverlust auftritt, wie es bei den bislang bekannten Mitteln der Fall ist. Für diesen Fall ist eine Kompensierung des Volumenverlustes etwa durch Einnahme einer erhöhten Stückzahl an Sättigungsmitteln erfindungsgemäß nicht erforderlich. Dies stellt einen angenehmen Nebeneffekt für den Verbraucher dar.

Darüber hinaus liegt bei dem erfindungsgemäßen Mittel das Gel oder der Schaum während der Einnahme durch den Patienten bevorzugt in komprimierter Form vor. In einer weiteren Ausführungsform kann das erfindungsgemäße Mittel auch während der Einnahme durch Kau- und/oder Schluckbewegungen komprimiert werden. Durch Aufnahme von Flüssigkeit im Magen erfolgt dann eine Volumenvergrößerung des eingenommen erfindungsgemäßen Mittels, die den gewünschten Effekt



der Erzeugung eines Sättigungseffektes, verbunden mit einer Gewichtsreduktion auslöst.

Ferner kann das erfindungsgemäße Mittel beispielsweise in Form von  
5 Tabletten, Kapseln, Dragees, als Granulat oder Pulver oder anderen  
Ausgestaltungen vorliegen. Darüber hinaus kann das erfindungsgemäße  
Mittel als eine äußere Schicht einen Überzug aufweisen. Erfindungsgemäß kann in einer Variante des erfindungsgemäßen  
Herstellungsverfahrens eine als Überzug bezeichnete äußere Schicht auf  
10 das erfindungsgemäße Mittel aufgebracht werden, die weitere Hilfsstoffe  
oder Wirkstoffe enthalten kann, wie beispielsweise Verbindungen, die das  
Schlucken oder Einnehmen des erfindungsgemäßen Mittels erleichtern  
und dem Fachmann unter „Coating“-Verbindungen oder als Dragiermittel  
bekannt sind. Diese äußere Schicht kann eine Lackschicht oder andere  
15 Schutzschicht sein, die die Einnahme des erfindungsgemäßen Mittels  
erleichtert und die sich erst im Gastrointestinaltrakt, beispielsweise unter  
Einfluß der Magenflüssigkeit, auflöst.

Das erfindungsgemäße Mittel kann auch weitere Hilfsstoffe und/oder  
20 Wirkstoffe enthalten.

Unter „Hilfsstoffen“ sind beispielsweise folgende Substanzen zu  
verstehen, die jedoch nicht limitierend für die vorliegende Erfindung sind:  
wasserunlösliche Hilfsstoffe oder Gemische davon, wie Lipide, u.a.  
25 Fettalkohole, z.B. Cetylalkohol, Stearylalkohol und Cetostearylalkohol;  
Glyceride, z.B. Glycerinmonostearat oder Gemische von Mono-, Di- und  
Triglyceriden pflanzlicher Öle; hydrierte Öle, wie hydriertes Rizinusöl oder  
hydriertes Baumwollsaamenöl; Wachse, z.B. Bienenwachs oder  
Carnaubawachs; feste Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin oder Erdwachs;  
30 Fettsäuren, z.B. Stearinsäure; gewisse Cellulosederivate, z.B.  
Ethylcellulose oder Acetylcellulose; Polymere oder Copolymere, wie

Polyalkylene, z.B. Polyäthylen, Polyvinylverbindungen, z.B. Polyvinylchlorid oder Polyvinylacetat, sowie Vinylchlorid-Vinylacetat-Copolymere und Copolymere mit Crotonsäure, oder Polymere und Copolymere von Acrylaten und Methacrylaten, z.B. Copolymerisate von  
5 Acrylsäureester und Methacrylsäuremethylester; oder Tenside, wie z.B. Polysorbat 80 oder Docusat.

Unter „Wirkstoffen“ sind beispielsweise Vitamine, Spurenelemente oder Arzneiwirkstoffe zu verstehen. Folgende Substanzen sind beispielhaft  
10 aufgezählt, die jedoch nicht limitierend für die vorliegende Erfindung sind:

Beispiele für Appetitzügler sind: Amfepramon, Fenfluramin, Fenproporex, Levopropylhexedrin, Mazindol, Mefenorex, Metamfepramon, Norephedrin, Norpseudoephedrin.

15 Beispiele für Virustatika sind: Aciclovir, Cidofovir, Didanosin, Famciclovir, Foscarnet, Ganciclovir, Lamivudin, Ritonavir, Zalcitabin, Zidovudin.

Beispiele für Vitamine sind: Alfacalcidol, Allithiamine, Ascorbinsäure, Biotin, Calcifediol, Calcitriol, Colecalciferol, Cyanocobalamin, Ergocalciferol, Folsäure, Hydroxocobalamin, Nicotinamid, Pantothensäure,  
20 Phytomenadion, Pyridoxin, Retinol, Riboflavin, Thiamin, Tocopherol, Transcalcifediol.

Unter Umständen kann hier zusätzlich eine retardierende Wirkstofffreisetzung erfolgen.

25

Außer den genannten Hilfsstoffen und Wirkstoffen kann das erfindungsgemäße Mittel zusätzlich Füll-, Spreng-, Binde- und Gleitmittel sowie Trägerstoffe enthalten, die auf die Wirkstoffabgabe keinen entscheidenden Einfluß haben. Beispiele sind u.a. Bentonit  
30 (Aluminiumoxid-Siliciumoxid-hydrat), Kieselsäure, Cellulose (üblicherweise mikrokristalline Cellulose) oder Cellulosederivate, z.B. Methylcellulose,

Natriumcarboxymethylcellulose, Zucker, wie Lactose, Stärken, z.B. Maisstärke oder Derivate davon, z.B. Natriumcarboxymethylstärke, Stärkel-eister, Phosphorsäuresalze, z.B. Di- oder Tricalciumphosphat, Gelatine, Stearinsäure oder geeignete Salze davon, z.B. Magnesiumstearat oder  
5 Calciumstearat, Talk, kolloidales Siliciumoxid und ähnliche Hilfsstoffe.

Die vorliegende Erfindung betrifft auch die Verwendung des erfindungsgemäßen Mittels zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion. Ebenso ist die Verwendung des  
10 erfindungsgemäßen Mittels zur Regulierung des Cholesterinhaushalts umfaßt.

Außerdem ist die Verwendung des erfindungsgemäßen Mittels zur Herstellung einer Zusammensetzung zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion denkbar. Gleichsam ist eine  
15 Verwendung des erfindungsgemäßen Mittels zur Herstellung einer Zusammensetzung zur Regulierung des Cholesterinhaushalts umfaßt.

Die vorliegende Erfindung wird durch die nachfolgenden Beispiele näher charakterisiert, die sich jedoch nicht limitierend auf die Erfindung auswirken:

5    Herstellungsbeispiel 1

|                  |       |
|------------------|-------|
| Natriumalginat   | 300 g |
| Aluminiumchlorid | 30 g  |
| Wasser           | 12 l  |

10    Herstellungsbeispiel 2

|                 |       |
|-----------------|-------|
| Natriumalginat  | 400 g |
| Aluminiumsulfat | 50 g  |
| Wasser          | 12 l  |

15    Herstellungsbeispiel 3

|                          |       |
|--------------------------|-------|
| Natriumalginat           | 200 g |
| Apfel- oder Citruspektin | 200 g |
| Aluminiumchlorid         | 30 g  |
| Wasser                   | 12 l  |

20

Herstellungsbeispiel 4

|                      |       |
|----------------------|-------|
| Natriumalginat       | 400 g |
| Magnesiumchlorid     | 4 g   |
| Aluminiumchlorid     | 20 g  |
| 25    Calciumchlorid | 10 g  |
| Wasser               | 12 l  |

Herstellungsbeispiel 5

|                        |       |
|------------------------|-------|
| Natriumalginat         | 300 g |
| 30    Aluminiumchlorid | 30 g  |
| Polysorbat 80          | 20 g  |

Wasser 12 l

Die Lösungen der zuvor genannten Rezepturen werden zu Platten mit  
5 einer Dicke von etwa 4 cm gefroren und anschließend im Gefriertrockner  
getrocknet. Nach der Trocknung kann ggf. eine Komprimierung erfolgen.  
Anschließend werden aus den Platten die entsprechenden  
Darreichungsformen, wie z.B. Tabletten oder Kapseln, hergestellt.

10 Anwendungsbeispiel

Getrocknete Aluminiumalginatgele werden in künstlichen Magen- und  
Darmsäften eingebracht und auf ihre Auflösung untersucht. Dabei sind die  
erfindungsgemäßen Aluminiumalginattrockengele in Lösungen von einem  
pH-Wert zwischen 1,2 und 4,5 unlöslich. In Lösungen mit pH 7 erfolgt eine  
15 vollständige Auflösung der erfindungsgemäßen  
Aluminiumalginattrockengele innerhalb von 30 Minuten.

**Ansprüche:**

1. Mittel zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion aus getrocknetem porösen Gel oder Schaum  
5 wenigstens eines anionischen Polymers, dadurch gekennzeichnet, daß es als Aluminiumsalz vorliegt.
2. Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß es in komprimierter Form vorliegt.  
10
3. Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß es als anionisches Polymer Alginat oder Pectin oder eine Kombination davon enthält.
- 15 4. Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß es als Aluminium-Alginat, Aluminium-Pektinat oder eine Kombination davon vorliegt.
5. Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet,  
20 daß es zusätzlich Wirkstoffe enthält.
6. Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß es als Wirkstoffe Vitamine, Spurenelemente oder Arzneiwirkstoffe enthält.  
25
7. Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß es in Form von Tabletten, Kapseln, Dragees, als Granulat oder Pulver verabreicht wird.
- 30 8. Verwendung eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7 zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion.

9. Verwendung eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7 zur Regulierung des Cholesterinhaushalts.

5 10. Verwendung eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7 zur Herstellung einer Zusammensetzung zur Erzeugung eines Sättigungseffektes und zur Gewichtsreduktion.

10 11. Verwendung eines Mittels gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7 zur Herstellung einer Zusammensetzung zur Regulierung des Cholesterinhaushalts.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/03910

| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>IPC 7 A61K9/20  |   |  |
|---|---|--|
| According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC   |   |  |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>IPC 7 A61K  |   |  |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched   |   |  |
| Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)<br>EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data  |   |  |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>   |   |  |
| Category *  | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No.  |
| X   | US 4 520 015 A (PESCHE BERNARD)<br>28 May 1985 (1985-05-28)<br>column 1, line 33 - line 57<br>column 2, line 54 - line 65<br>column 3, line 11 - line 28<br>claims 1,10,12                    | 1-11   |
| X   | GB 1 474 891 A (INST ELEMENTOORGANICHE<br>SOEDINE) 25 May 1977 (1977-05-25)<br>page 2, column 1, line 32 - line 62<br>page 3, column 1, line 30 - line 38<br>page 8, column 2; examples 20,21 | 1-11   |
| X   | GB 1 106 664 A (SARTORIUS MEMBRANFILTER<br>GMBH) 20 March 1968 (1968-03-20)<br>page 2, column 2; example 1  | 1-11   |
| -/--  |   |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C.  |   |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.  |   |  |
| <b>* Special categories of cited documents :</b><br><div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div style="width: 45%;"> <p>*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>*E* earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>*L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>*P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> </div> <div style="width: 45%;"> <p>*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>*X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>*Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>*8* document member of the same patent family</p> </div> </div> |   |  |
| Date of the actual completion of the international search<br><br>3 July 2003  |   | Date of mailing of the international search report<br><br>30/07/2003 |
| Name and mailing address of the ISA<br>European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2<br>NL - 2280 HV Rijswijk<br>Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,<br>Fax: (+31-70) 340-3016  |   | Authorized officer<br><br>Muller, S                                  |



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern ... I Application No  
PCT/EP 03/03910

| C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT |   |                       |
|--|---|-----------------------|
| Category *   | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
| X  | <p>WO 00 19979 A (GILCHRIST TOM ;GILTECH LTD<br/>(GB); TRAINER EILIDH (GB))<br/>13 April 2000 (2000-04-13)<br/>page 13; example 1<br/>page 20; example 9<br/>page 21; example 11<br/>claims 1-24</p> <p>-----</p> | 1-11                  |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP03/03910

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
  
Although Claims 8-11 relate to a method for treatment of the human or animal body, the search was carried out on the basis of the alleged effects of the agent.
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No  
PCT/EP 03/03910

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s)   | Publication<br>date  |
|---|---|---------------------|--|--|
| US 4520015                                | A | 28-05-1985          | FR 2528279 A1<br>AT 21804 T<br>DE 3365850 D1<br>EP 0097093 A1                      | 16-12-1983<br>15-09-1986<br>09-10-1986<br>28-12-1983               |
| GB 1474891                                | A | 25-05-1977          | BE 829907 A1   | 01-10-1975   |
| GB 1106664                                | A | 20-03-1968          | DE 1470890 A1<br>FR 1456501 A  | 20-02-1969<br>11-01-1967   |
| WO 0019979                                | A | 13-04-2000          | AU 6216299 A<br>CA 2338337 A1<br>EP 1117379 A1<br>WO 0019979 A1<br>JP 2002526398 T | 26-04-2000<br>13-04-2000<br>25-07-2001<br>13-04-2000<br>20-08-2002 |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 03/03910

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 A61K9/20

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| X          | US 4 520 015 A (PESCHE BERNARD)<br>28. Mai 1985 (1985-05-28)<br>Spalte 1, Zeile 33 - Zeile 57<br>Spalte 2, Zeile 54 - Zeile 65<br>Spalte 3, Zeile 11 - Zeile 28<br>Ansprüche 1,10,12<br>---                   | 1-11               |
| X          | GB 1 474 891 A (INST ELEMENTOORGANICHE<br>SOEDINE) 25. Mai 1977 (1977-05-25)<br>Seite 2, Spalte 1, Zeile 32 - Zeile 62<br>Seite 3, Spalte 1, Zeile 30 - Zeile 38<br>Seite 8, Spalte 2; Beispiele 20,21<br>--- | 1-11               |
| X          | GB 1 106 664 A (SARTORIUS MEMBRANFILTER<br>GMBH) 20. März 1968 (1968-03-20)<br>Seite 2, Spalte 2; Beispiel 1<br>---   | 1-11               |
|            | ---<br>-/-  |                    |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

3. Juli 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

30/07/2003

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Muller, S

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern. des Aktenzeichen  
PCT/EP 03/03910

| C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN |   |                    |
|--|---|--------------------|
| Kategorie*   | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
| X  | <p>WO 00 19979 A (GILCHRIST TOM ;GILTECH LTD<br/>(GB); TRAINER EILIDH (GB))<br/>13. April 2000 (2000-04-13)<br/>Seite 13; Beispiel 1<br/>Seite 20; Beispiel 9<br/>Seite 21; Beispiel 11<br/>Ansprüche 1-24</p> <p>-----</p> | 1-11               |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 03/03910

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☒ Ansprüche Nr.   
 weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich  
Obwohl die Ansprüche 8-11 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen des Mittels.
2. ☐ Ansprüche Nr.   
 weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.   
 weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese Internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

7

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung      zur selben Patentfamilie gehören

Internat. Aktenzeichen  
PCT/EP 03/03910

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie  | Datum der<br>Veröffentlichung                                      |
|--|-------------------------------|--|--|
| US 4520015      A                                  | 28-05-1985                    | FR 2528279 A1<br>AT 21804 T<br>DE 3365850 D1<br>EP 0097093 A1                      | 16-12-1983<br>15-09-1986<br>09-10-1986<br>28-12-1983               |
| GB 1474891      A                                  | 25-05-1977                    | BE 829907 A1   | 01-10-1975   |
| GB 1106664      A                                  | 20-03-1968                    | DE 1470890 A1<br>FR 1456501 A  | 20-02-1969<br>11-01-1967   |
| WO 0019979      A                                  | 13-04-2000                    | AU 6216299 A<br>CA 2338337 A1<br>EP 1117379 A1<br>WO 0019979 A1<br>JP 2002526398 T | 26-04-2000<br>13-04-2000<br>25-07-2001<br>13-04-2000<br>20-08-2002 |